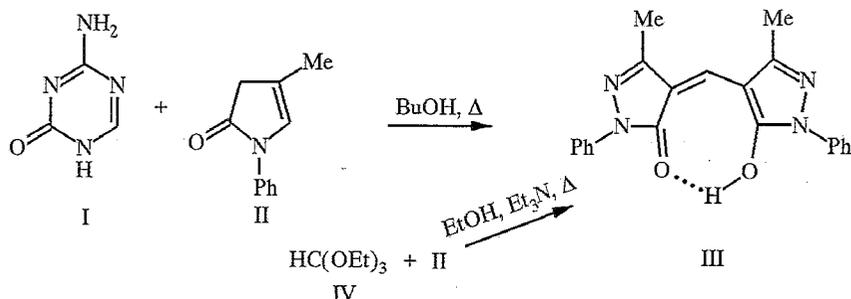


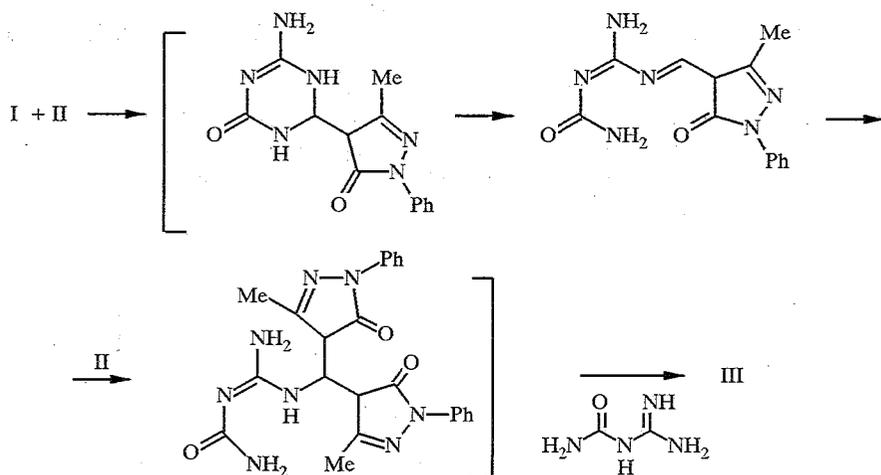
О ВЗАИМОДЕЙСТВИИ 5-АЗАЦИТОЗИНА С 3-МЕТИЛ-1-ФЕНИЛПИРАЗОЛОНОМ-5

Известно, что 1,3-диметил-*s*-триазин-2,4-(1H,3H)дион в присутствии оснований при взаимодействии с гуанидином превращается в 5-азацитозин, с мочевиной — в 5-азаурацил, с малонамидом — в урацил-5-карбоксамид, а с цианамидом — в 5-цианоурацил [1]. Из амида фторуксусной кислоты и 1,3-диметил-5-азаурацила в присутствии диизопропиламида лития образуется 5-фторурацил [2].

Нами обнаружено, что нагревание в кипящем бутаноле 5-азацитозина (I) и 3-метил-1-фенилпиразолона-5 (II) приводит с выходом 40...45% к дипиразолилметану (III), идентичному образцу этого соединения, синтезированному нами ранее иным путем в работе [3].



Механизм образования продукта III можно представить следующей схемой:



Дипиразолилметан III получен нами также при нагревании пиразолона II с ортомуравьиным эфиром (IV) в этаноле в присутствии триэтиламина. В то же время при нагревании этих реагентов в кипящем бутаноле без триэтиламина каких-либо превращений пиразолона II не наблюдалось.

Следует особо отметить также, что известные трансформации производных 1,3,5-триазина осуществляют в присутствии сильных оснований (активация реагента зарядом). Обнаруженная нами реакция является первым примером трансформации 5-азацитозина с незаряженным C-нуклеофилом.

Ди-3-метил-(1-фенил-5-оксопиразолил-4)метан (III). А. Кипятят 0,224 г (2,0 ммоль) 5-азацитозина I и 0,696 г (4,0 ммоль) 3-метил-1-фенилпиразолона-5 II в 5 мл бутанола в течение 4 ч. Реакционную массу охлаждают, выпавший осадок отфильтровывают, перекристаллизовывают из ДМФА. Получают 0,320 г (45%) продукта III.

Б. Кипятят смесь 0,3 г (1,74 ммоль) соединения II, 1,6 г (10,8 ммоль) ортомуравьиного эфира и 0,3 мл триэтиламина в 5 мл этанола 3 ч. Реакционную массу охлаждают до 20...25 °С и нейтрализуют 10% раствором соляной кислоты до pH 6,5...7. Выделившийся осадок отфильтровывают и перекристаллизовывают из ДМФА. Получают 0,26 г (42%) соединения III.

Продукты, полученные по методикам А и Б, идентичны, по данным ИК спектров, образцу соединения, описанному в работе [3].

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ

1. Chung W. K., Chu C. K., Watanabe K. A., Fox J. J. // J. Org. Chem. — 1979. — Vol. 44. — P. 3982.
2. Chung W. K., Chung J. H., Watanabe K. A. // J. Heterocycl. Chem. — 1983. — Vol. 20. — P. 457.
3. Azev Yu. A., Neunhoeffler H., Foro S., Lindner H. J., Shorshnev S. V. // Mendeleev Commun. — 1995. — N 6. — P. 229.

Ю. А. Азев, И. В. Тепляшина, Б. В. Голомолзин

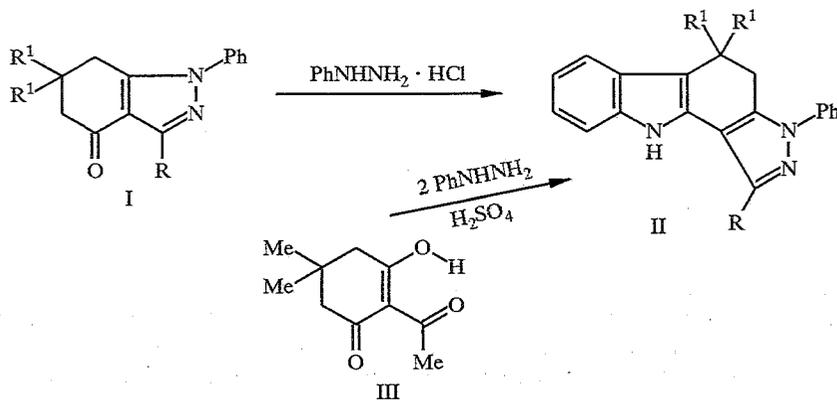
Уральский научно-исследовательский институт технологии медицинских препаратов, Екатеринбург 620219
ХГС. — 1997. — № 9. — С. 1273

Поступило в редакцию 11.08.97

ИНДОЛИЗАЦИЯ

1-АРИЛ-4-ОКСО-4,5,6,7-ТЕТРАГИДРОИНДАЗОЛОВ ПО ФИШЕРУ

С учетом кардиотонической активности пиридо[2,3-с]- и пирано[2,3-с]-карбазолов [1] нами в развитие работ [2] по синтезу конденсированных систем на базе производных 4,5,6,7-тетрагидроиндазола в реакциях индолизации 1-фенил-4-оксо-4,5,6,7-тетрагидроиндазолов (I) синтезированы пиразоло[4,5-с]карбазолы (II).



I, II а R = Me, R¹ = H; б R = R¹ = Me; в R = H, R¹ = Me

Реакции индолизации проведены кипячением эквимольных количеств 4-оксо-4,5,6,7-тетрагидроиндазолов с гидрохлоридом фенилгидразина в ледяной уксусной кислоте. Показано также, что взаимодействие 2-ацетилдимедона (III) с избытком фенилгидразина в присутствии H₂SO₄ ведет к пиразоло[4,5-с]карбазолу IIб. Строение пиразолокарбазолов II подтверждается данными ИК и ПМР спектров. Так, в ИК спектрах соединений II